

[Chem. Pharm. Bull., 32, 1761 (1984)]

Fused 1, 3-Oxazine Derivatives. Synthesis of 2H-1, 3-Oxazino [5, 6-b] quinoxaline-2, 4(3H)-diones (1-Oxaalloxazines), 2H-1, 3-Oxazino [6, 5-b] quinoline-2, 4(3H)-diones (5-Deaza-1-oxaalloxazines), and 2H-Pyrido [3, 2-e]-1, 3-oxazine-2, 4 (3H)-diones

MOTOI YOGO*, KOSAKU HIROTA, YOSHIFUMI MAKI,
SHIGEO SENDA

縮合 1, 3-Oxazine 誘導体。2H-1, 3-Oxazino [5, 6-b] quinoxaline-2, 4 (3H)-dione 類 (1-Oxaalloxazine 類), 2H-1, 3-Oxazino [6, 5-b]quinoline-2, 4(3H)-dione 類 (5-Deaza-1-oxaalloxazine 類), および 2H-Pyrido [3, 2-e]-1, 3-oxazine-2, 4 (3H)-dione 類の合成

余合 基*, 広田耕作, 牧 敬文, 千田重男

本研究では, 1, 3-oxazine-2, 4-dione を uracil の isostere と見なし種々の縮合 1, 3-oxazine 誘導体の合成を検討した。6-anilino-3-methyl-2H-1, 3-oxazine-2, 4 (3H)-dione (1a) と triethyl orthoformate および diethyl azodicarboxylate との反応では 3-methyl-5-deaza-1-oxaalloxazine および 3-methyl-1-oxaalloxazine が生成した。さらに (1a) と dimethyl acetylenedicarboxylate との反応では methyl 3-methyl-2, 4, 7-trioxo-8-phenyl-3, 4, 7, 8-tetrahydro-2H-pyrido [3, 2-e]-1, 3-oxazine-5-carboxylate および methyl-2, 5-dioxo-1, 3, 5, 10-tetrahydrobenzo [b] [1, 8] naphthyridine-4-carboxylate が生成した。

* 名城大学薬学部

[J. Chem. Soc. Perkin 1, 1984, 2097]

Synthesis of 5-Iminopyrrolo-2-one Derivatives from 1, 3-Oxazines. Ring Transformation *via* Attack on the 2- or 6-Position of 1, 3-Oxazines

MOTOI YOGO*, KOSAKU HIROTA, YOSHIFUMI MAKI

1, 3-Oxazine 類から 5-Iminopyrrol-2-one 誘導体の合成。1, 3-Oxazine 類の2位または6位への攻撃を経る環変換反応

余合 基*, 広田耕作, 牧 敬文

1, 3-oxazine 誘導体は種々の求核試薬との反応により他の複素環へ環変換することが知られている。これらの反応は, まず2位への求核攻撃により惹起されることが多数の研究により示されてきた。

今回, 2H-1, 3-oxazine-2, 4 (3H)-dione 類 (1) とソフトな求核試薬であるシアンアニオンとの反応で求核試薬の攻撃が2位と共に6位にも起る初めてのタイプの環変換反応を見いだした。(1) を DMF 中 KCN と反応させれば 5-imino-1, 4-dimethyl-5-dihydro-2H-pyrrol-2-one (2), 3-acetyl-4-amino-1-methyl-1H-pyrrole-2, 5-dione (3) および (E)-3-cyanoacrylamide (4) が生成した。(2) は CN⁻ が6位を (3) は2位をそれぞれ攻撃した後開環—再開環過程を経て生成したものである。(4) は反応中間体と考えられ, 触媒量の KCN 存在下 (4) を光反応すると環化して 5-iminopyrrol-2-one (2) を与えた。生成した iminopyrrole 類は塩酸により対応する 1H-pyrrole-2, 5-dione 誘導体に加水分解された。

* 名城大学薬学部